

⑨ 日本国特許庁 (JP)

⑩ 特許出願公開

⑪ 公開特許公報 (A) 昭63-201199

⑫ Int. Cl.

C 07 K 7/20
A 61 K 37/24
C 07 K 1/06
// C 07 K 99/54

識別記号

A F B

序内整理番号

8318-4H
8615-4C

⑬ 公開 昭和63年(1988)8月19日

審査請求 未請求 請求項の数 26 (全32頁)

⑭ 発明の名称 LHRH拮抗体として有用なLHRHのノナペプチドおよびデカペプチド類似体

⑮ 特願 昭63-26418

⑯ 出願 昭63(1988)2月4日

優先権主張 ⑰ 1987年2月5日⑮米国(US)⑯010,923

⑰ 発明者 ジョン・ジェイ・ネス アメリカ合衆国カリフォルニア 95133、サン・ノゼ、カーター、ジュニア 一ク・グレン・ドライブ 677番

⑱ 発明者 ブライアン・エイチ・ヴィツカリー アメリカ合衆国カリフォルニア 95070、サラトガ、キヤロル・レーン 20279番

⑲ 出願人 シンテツクス(ユー・エス・エイ)インコート、ヒルビュー・アベニュー 3401番
ボレイテッド

⑳ 代理人 弁理士 青山 葦 外1名

明細書

1. 発明の名称

LHRH 拮抗体として有用なLHRHのノナペプチド
およびデカペプチド類似体

Bは、D-フェニルアラニル、D-p-クロロ

フェニルアラニル、D-p-フルオロフェニルアラニル、D-p-ニトロフェニルアラニル、2,2-ジフェニルグリシル、D- α -メチル-p-クロロフェニルアラニルおよび3-(2-ナフチル)-D-アラニルから成る群から選ばれたアミノアシル残基、

Cは、D-トリプトファン、D-フェニルアラニル、3-(3-ビリジル)-D-アラニルおよび3-(2-ナフチル)-D-アラニルから成る群から選ばれたアミノアシル残基、

Dは、L-フェニルアラニル、L-チロシルおよび3-(3-ビリジル)-アラニルから成る群から選ばれたアミノアシル残基、アルギニルまたはG、

Eは、3-(2-ナフチル)-D-アラニル、3-(3-ビリジル)-D-アラニル、D-チロシル、D-トリプトファン、D-ニコチニル-リジル、ビリジルアセチル-リジル、D-Glu(AA)またはG、

2. 特許請求の範囲

(1)式

A-B-C-Ser-D-E-F-G-Pro-J (1)

1 2 3 4 5 6 7 8 9 10

[式中、

Aは、N-Ac-D,L- $\Delta^{1,4}$ -プロリル、N-Ac-D,L-プロリル、N-Ac-D,L-フェニルアラニル、N-Ac-D,L-p-クロロフェニルアラニル、N-Ac-D,L-p-フルオロフェニルアラニル、N-Ac-3-(1-ナフチル)-D,L-アラニル、N-Ac-3-(2-ナフチル)-D,L-アラニルおよびN-Ac-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-D,L-アラニルのD-またはL-異性体から成る群から選ばれたアミノアシル残基、